

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international(43) Date de la publication internationale
23 mai 2002 (23.05.2002)

PCT

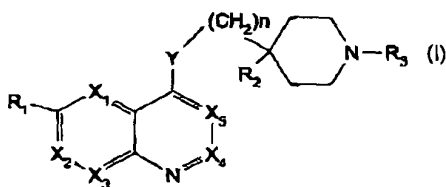
(10) Numéro de publication internationale
WO 02/40474 A2(51) Classification internationale des brevets⁷ :
C07D 409/14, 401/06,
401/14, 417/14, A61K 31/47, A61P 31/04(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR01/03559(22) Date de dépôt international :
14 novembre 2001 (14.11.2001)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
00/14738 15 novembre 2000 (15.11.2000) FR(71) Déposant : AVENTIS PHARMA S.A. [FR/FR]; 20 av-
enue Raymond Aron, F-92160 ANTONY (FR).(72) Inventeurs: BACQUÉ, Eric; 123 allée de la Clair-
ière, F-91190 GIF SUR YVETTE (FR). CARRY,
Jean-Christophe; 41 rue du Dauphiné, F-94100 SAINT
MAUR DES FOSSES (FR). EL-AHMAD, Youssef; 11
avenue de Verdun, F-94000 CRETEIL (FR). EVERS,
Michel; 8 rue Robert Schumann, F-94510 LA QUEUE ENBRIE (FR). HUBERT, Philippe; 22 rue Georges Gaume,
F-94700 MAISONS-ALFORT (FR). MALLERON,
Jean-Luc; 2 allée Renoir, F-91460 MARCOUSSIS (FR).
MIGNANI, Serge; 14 avenue de Robinson, F-92290
CHATENAY-MALABRY (FR). PANTEL, Guy; 12 rue
Jean-Baptiste Clément, F-94510 LA QUEUE EN BRIE
(FR). TABART, Michel; 3 rue Paul Langevin, F-91290
LA NORVILLE (FR). VIVIANI, Fabrice; 46 rue Jules
Fossier, F-95380 LOUVRES (FR).(74) Mandataire : LOBJOIS, Françoise; AVENTIS
PHARMA S.A., Direction Brevets, 20 avenue Ray-
mond Aron, F-92165 ANTONY CEDEX (FR).(81) États désignés (national) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ,
BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ,
DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,
MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI,
SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA,
ZW.(84) États désignés (régional) : brevet ARIPO (GH, GM, KE,
LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), brevet eurasien
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen
(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU,

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: HETEROCYCLYLALKYL PIPERIDINE DERIVATIVES, THEIR PREPARATION AND COMPOSITIONS
CONTAINING SAME(54) Titre : DERIVES HETEROCYCLYLALCOYL PIPERIDINE, LEUR PREPARATION ET LES COMPOSITIONS QUI LES
CONTIENNENT(57) Abstract: The invention concerns heterocyclylalkyl piperidine
derivatives of general formula (I), wherein X₁, X₂, X₃, X₄ and X₅ are >C-R'₁
to >C-R'₅ or one at most represents N; R₂ is COOH, alkoxyoxycarbonyl,
cycloalkoxyoxycarbonyl, CN, -CONRaRb or R₂ is CH₂OH, alkyl substituted
or R₂ is -CF₂-Rc, -C(CH₃)₂-Rc, -CO-Rc, -CHOH-Rc, -C(cycloalkyl)-Rc or
-CH=CH-Rc; R₃ is phenyl, heterocyclyl, alk-R₃; Y represents >CH-Rc or a
difluoromethylene, carbonyl, hydroxyiminomethylene, alkoxyiminomethy-
lene, cycloalkoxyiminomethylene radical, or a cycloalkylene-1,1 radical;and n = 0 to 4 provided that the radicals or phenyl or heterocyclyl portions mentioned above can optionally be substituted, in the
enantiomeric or diastereoisomeric forms or mixtures thereof, and/or as the case may be in their syn or anti form or mixture thereof
and their salts.(57) Abrégé : Dérivés hétérocyclylalcoyl pipéridine de formule générale (I) pour lesquels: X₁, X₂, X₃, X₄ et X₅ sont >C-R'₁ à
>C-R'₅ ou bien l'un au plus représente N, R₂ est COOH, alcoyloxyoxycarbonyl, cycloalcoyloxyoxycarbonyl, CN, -CONRaRb ou R₂
est CH₂OH, alcoyle substitué ou R₂ est -CF₂-Rc, -C(CH₃)₂-Rc, -CO-Rc, -CHOH-Rc, -C(cycloalcoyle)-Rc ou -CH=CH-Rc, R₃ est
phényle, hétérocyclyle, alk-R₃, Y représente >CH-Rc ou un radical difluorométhylène, carbonyle, hydroxyiminométhylène, alcoy-
loxyiminométhylène, cycloalcoyloxyiminométhylène, ou un radical cycloalcoylène-1,1, et n = 0 à 4 étant entendu que les radicaux
ou portions phényle ou hétérocyclyle mentionnés ci-dessus peuvent être éventuellement substitués, sous leurs formes énantiomères
ou diastéréoisomères ou les mélanges de ces formes, et/ou le cas échéant sous leur forme syn ou anti ou leur mélange ainsi que leurs
sels.

WO 02/40474 A2